

PCT

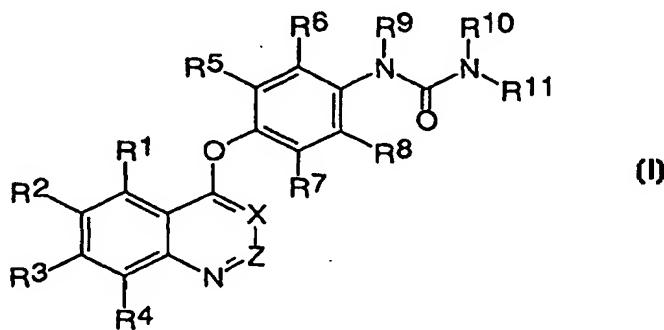
世界知的所有権機関  
国際事務局  
特許協力条約に基づいて公開された国際出願



(51) 国際特許分類7 C07D 215/22, 239/96, 401/12, 403/12, A61P 35/00, A61K 31/47, 31/4725, 31/496, 31/517, 31/5355	A1	(11) 国際公開番号 <b>WO00/43366</b> (43) 国際公開日 2000年7月27日(27.07.00)
(21) 国際出願番号 PCT/JP00/00255		(74) 代理人 佐藤一雄, 外(SATO, Kazuo et al.) 〒100-0005 東京都千代田区丸の内三丁目2番3号 富士ビル323号 協和特許法律事務所 Tokyo, (JP)
(22) 国際出願日 2000年1月20日(20.01.00)		
(30) 優先権データ 特願平11/14858 1999年1月22日(22.01.99) JP 特願平11/26691 1999年2月3日(03.02.99) JP 特願平11/142493 1999年5月21日(21.05.99) JP 特願平11/253624 1999年9月7日(07.09.99) JP		(81) 指定国 AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM)
(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 麒麟麦酒株式会社 (KIRIN BEER KABUSHIKI KAISHA)[JP/JP] 〒104-8288 東京都中央区新川二丁目10番1号 Tokyo, (JP)		
(72) 発明者 ; および (75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ) 久保和生(KUBO, Kazuo)[JP/JP] 〒370-0852 群馬県高崎市中居町4-17-9 キリン中居寮207号室 Gumma, (JP) 藤原康成(FUJIWARA, Yasunari)[JP/JP] 〒370-1202 群馬県高崎市宮原町12-210 Gumma, (JP) 磯江敏幸(ISOE, Toshiyuki)[JP/JP] 〒370-1206 群馬県高崎市台新田町330-28 Gumma, (JP)		添付公開書類 国際調査報告書

(54)Title: QUINOLINE DERIVATIVES AND QUINAZOLINE DERIVATIVES

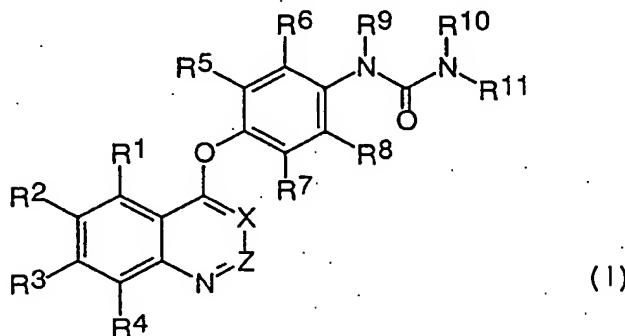
(54)発明の名称 キノリン誘導体およびキナリゾン誘導体



## (57) Abstract

Compounds having an antitumor activity and causing no morphological change in cells. Compounds of general formula (I), pharmaceutically acceptable salts of them and solvates thereof, and medicinal compositions containing the same. In formula (I), X and Z represent each CH or N; R<sup>1-3</sup> represent each H, optionally substituted alkoxy, etc.; R<sup>4</sup> represents H; R<sup>5-8</sup> represent each H, halogeno, alkyl, alkoxy, alkylthio, nitro or amino, provided that all of R<sup>5-8</sup> do not represent H simultaneously; R<sup>9</sup> and R<sup>10</sup> represent each H, alkyl or alkylcarbonyl; and R<sup>11</sup> represents alkyl, alkenyl, alkynyl or aralkyl.

本発明は抗腫瘍活性を有しつつ細胞形態変化を生じさせない化合物の提供をその目的とする。式(I)の化合物およびその薬学上許容される塩および溶媒和物並びにこの化合物を含む医薬組成物が開示される。



(XおよびZはC HまたはNを表し、R<sup>13</sup>はH、置換アルコキシ、非置換アルコキシ等を表し、R<sup>14</sup>はHを表し、R<sup>15</sup>はH、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ニトロまたはアミノを表すが、R<sup>15</sup>が総てHを表すことはなく、R<sup>16</sup>およびR<sup>17</sup>はH、アルキル、アルキルカルボニルを表し、R<sup>18</sup>はアルキル、アルケニル、アルキニルまたはアラルキルを表す)

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AE	アラブ首長国連邦	DM	ドミニカ	KZ	カザフスタン	RU	ロシア
AG	アンティグア・バーブーダ	DZ	アルジェリア	LC	セントルシア	SD	スードン
AL	アルバニア	EE	エストニア	LI	リヒテンシュタイン	SE	スウェーデン
AM	アルメニア	ES	スペイン	LK	スリ・ランカ	SG	シンガポール
AT	オーストリア	FI	フィンランド	LR	リベリア	SI	スロヴェニア
AU	オーストラリア	FR	フランス	LS	レソト	SK	スロヴァキア
AZ	アゼルバイジャン	GA	ガボン	LT	リトアニア	SL	シエラ・レオネ
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GB	英国	LU	ルクセンブルグ	SN	セネガル
BB	バルバドス	GD	グレナダ	LV	ラトヴィア	SZ	スウェーデン
BE	ベルギー	GE	グルジア	MA	モロッコ	TD	チャード
BF	ブルガリア・ファソ	GH	ガーナ	MC	モナコ	TG	トーゴー
BG	ブルガリア	GM	ガンビア	MD	モルドavia	TJ	タジキスタン
BJ	ベナン	GN	ギニア	MG	マダガスカル	TM	トルクメニスタン
BR	ブラジル	GR	ギリシャ	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア	TR	トルコ
BY	ベラルーシ	GW	ギニア・ビサオ	ML	マリ	TT	トリニダッド・トバゴ
CA	カナダ	HR	クロアチア	MN	モンゴル	UA	ウクライナ
CF	中央アフリカ	HU	ハンガリー	MR	モーリタニア	UG	ウガンダ
CG	コンゴー	ID	インドネシア	MW	マラウイ	US	米国
CH	イスス	IE	アイルランド	MX	メキシコ	UZ	ウズベキスタン
CI	コートジボアール	IL	イスラエル	MZ	モザンビーク	VN	ベトナム
CM	カメルーン	IN	インド	NE	ニジェール	YU	ユーゴースラヴィア
CN	中国	IS	アイスランド	NL	オランダ	ZA	南アフリカ共和国
CR	コスタ・リカ	IT	イタリア	NO	ノールウェー	ZW	ジンバブエ
CU	キューバ	JP	日本	NZ	ニュージーランド		
CY	キプロス	KE	ケニア	PL	ポーランド		
CZ	チェコ	KG	キルギスタン	PT	ポルトガル		
DE	ドイツ	KP	北朝鮮	RO	ルーマニア		
DK	デンマーク	KR	韓国				

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号  
特開2003-286263  
(P2003-286263A)

(43)公開日 平成15年10月10日 (2003.10.10)

(51)Int.Cl.<sup>7</sup>  
C 07 D 215/22  
A 61 K 31/47  
31/4709  
31/517  
31/5377

識別記号

F I  
C 07 D 215/22  
A 61 K 31/47  
31/4709  
31/517  
31/5377

テマコード<sup>\*</sup>(参考)  
4 C 031  
4 C 063  
4 C 086

審査請求 未請求 請求項の数52 O L (全 99 頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2003-128216(P2003-128216)  
(62)分割の表示 特願2000-594782(P2000-594782)の分割  
(22)出願日 平成12年1月20日(2000.1.20)  
  
(31)優先権主張番号 特願平11-14858  
(32)優先日 平成11年1月22日(1999.1.22)  
(33)優先権主張国 日本(J P)  
  
(31)優先権主張番号 特願平11-26691  
(32)優先日 平成11年2月3日(1999.2.3)  
(33)優先権主張国 日本(J P)  
  
(31)優先権主張番号 特願平11-142493  
(32)優先日 平成11年5月21日(1999.5.21)  
(33)優先権主張国 日本(J P)

(71)出願人 000253503  
麒麟麦酒株式会社  
東京都中央区新川二丁目10番1号  
(72)発明者 久保和生  
群馬県高崎市中居町4-17-9 キリン中居寮207号室  
(72)発明者 藤原康成  
群馬県高崎市宮原町12-210  
(72)発明者 磯江敏幸  
群馬県高崎市台新田町330-28  
(74)代理人 100075812  
弁理士 吉武賢次(外3名)

最終頁に続く

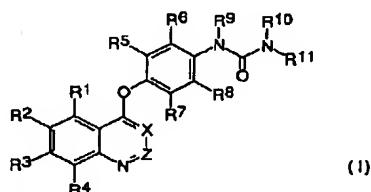
(54)【発明の名称】キノリン誘導体およびキナゾリン誘導体

(57)【要約】

【課題】抗腫瘍活性を有しかつ細胞形態変化を生じさせない化合物の提供。

【解決手段】式(I)の化合物およびその薬学上許容される塩および溶媒和物並びにこの化合物を含む医薬組成物。

【化1】



(XおよびZはC HまたはNを表し、R<sup>1-3</sup>はH、置換アルコキシ、非置換アルコキシ等を表し、R<sup>4</sup>はHを表し、R<sup>5-8</sup>はH、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ニトロまたはアミノを表すが、R<sup>5-8</sup>が総てHを表すことはなく、R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>はH、アルキル、アルキルカルボニルを表し、R<sup>11</sup>はアルキル、アルケニル、アルキニルまたはアラルキルを表す)